

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
7 octobre 2004 (07.10.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
**WO 2004/084856 A3**

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup> : **A61K 9/16**

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR2004/000729

(22) Date de dépôt international : 24 mars 2004 (24.03.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
03/03568 24 mars 2003 (24.03.2003) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) :  
**ORALANCE PHARMA** [FR/FR]; Incubateur Paris  
Biotech, 24 rue du Faubourg Saint Jacques, F-75014 Paris  
(FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) :  
**IOUALALEN, Karim** [FR/FR]; 8, avenue du Cous-  
tou, F-31650 Saint Orens de Gameville (FR). **RAYNAL,**  
**Rose, Anne** [FR/FR]; 8 avenue du Coustou, F-31650 Saint  
Orens de Gameville (FR).

(74) Mandataires : **BREESE, Pierre** etc.; Breesé-Majerowicz,  
3 avenue de l'Opéra, F-75001 Paris (FR).

(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de  
protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT,

AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO,  
CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,  
GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG,  
KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG,  
MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH,  
PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN,  
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de  
protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH, GM,  
KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasi-  
en (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), européen (AT,  
BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR,  
HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),  
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,  
MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

— avec rapport de recherche internationale  
— avant l'expiration du délai prévu pour la modification des  
revendications, sera republiée si des modifications sont re-  
çues

(88) Date de publication du rapport de recherche  
internationale: 25 novembre 2004

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abrégia-  
tions, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et  
abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de  
la Gazette du PCT.

(54) Title: NOVEL GALENICAL SYSTEM FOR ACTIVE TRANSPORT, METHOD FOR PREPARATION AND USE

(54) Titre : NOUVEAU SYSTÈME GALENIQUE POUR LE TRANSPORT D'ACTIF, PROCÉDE DE PREPARATION ET UTI-  
LISATION

(57) Abstract: The invention relates to a novel galenical system for taste masking, protecting an active substance, in particular in an acid medium, modulating releasing properties, masking mucous irritability and toxicity of certain active substances, for preparing aqueous forms which have a masked taste, are stable and pH independent. Said invention also relates, in particular to a galenical system which is embodied in the form of lipidic solid particles and strictly hydrophobic and devoid of water, surface active agents, emulsifiers, solvent traces and which is characterised in that it comprises at least one type of hydrophobic wax and at least one type of fatty non-neutralised acid.

(57) Abrégé : L'invention propose un nouveau système galénique permettant le masquage du goût, la protection du principe actif, particulièrement en milieu acide, la possibilité de modulation des propriétés de libération, le masquage des effets d'irritabilité mu-  
cosale et de la toxicité de certains principes actifs, la préparation de formes aqueuses, à goût masqué, stables et pH indépendantes. Particulièrement, l'invention a pour objet un système galénique, sous forme de particules lipidiques solides, strictement hydrophobes ne contenant strictement pas d'eau, ni de tensioactifs, ni d'agents émulsionnants, ni de traces de solvants, caractérisé en ce qu'il com-  
prend au moins une cire hydrophobe et au moins un acide gras non neutralisé.

WO 2004/084856 A3

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/FR2004/000729

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
IPC 7 A61K9/16

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
IPC 7 A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 94/12157 A (KV PHARMACEUTICAL COMPANY) 9 June 1994 (1994-06-09) claims 1-3,6-8 page 9, line 1 - line 6 page 14, line 4 - line 19 page 17; example 1 page 19; example 4	1-7,9
X	WO 99/65448 A (IOULALEN, KARIM; ET AL.) 23 December 1999 (1999-12-23) cited in the application claims 1-5,13-16 page 9; example 6	15-17

-/--

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

**\* Special categories of cited documents:**

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*Z\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  7 October 2004	Date of mailing of the international search report  18/10/2004
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer  Boulois, D

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/FR2004/000729

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 1 197 207 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 17 April 2002 (2002-04-17) claims 1,13-16 page 5, line 43 - page 6, line 9 page 6; examples 1-4	1-4,6-9
X	US 4 132 753 A (MITCHELL S. BLICHARE) 2 January 1979 (1979-01-02) claims 1,2	1-4,6,7, 9
A	EP 0 911 038 A (SALSARULO, ODETTE; ET AL.) 28 April 1999 (1999-04-28) claims 1-3 examples 1-3	1-4,6,7, 9
X	WO 00/76481 A (CIP NINETY TWO 92 S A ; AJANI MAURO (PA); VILLA ROBERTO (PA); FOSSATI) 21 December 2000 (2000-12-21) page 7 - page 10; examples	1-14, 18-20
X	GB 1 323 161 A (WYETH JOHN & BROTHER LTD) 11 July 1973 (1973-07-11)  page 2 - page 3; examples	1-6, 8-14, 18-20
X	WO 00/76478 A (CIP NINETY TWO 92 S A ; AJANI MAURO (PA); VILLA ROBERTO (PA); FOSSATI) 21 December 2000 (2000-12-21) page 15; example 8	1-10, 12-14, 18-20
X	WO 99/13864 A (SHIRE LAB INC) 25 March 1999 (1999-03-25) page 2, paragraph 3 page 9, paragraph 1 page 41 - page 42; example 8	1-14, 18-20

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

FR/FR2004/000729

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9412157	A	09-06-1994	AU 5681294 A	22-06-1994
			CA 2150119 A1	09-06-1994
			DE 69332801 D1	30-04-2003
			DE 69332801 T2	29-01-2004
			EP 0670716 A1	13-09-1995
			ES 2194863 T3	01-12-2003
			JP 2949448 B2	13-09-1999
			JP 8505841 T	25-06-1996
			KR 168715 B1	15-01-1999
			WO 9412157 A1	09-06-1994
			US 5494681 A	27-02-1996
WO 9965448	A	23-12-1999	FR 2779962 A1	24-12-1999
			AU 4151099 A	05-01-2000
			CA 2341580 A1	23-12-1999
			EP 1030687 A2	30-08-2000
			WO 9965448 A2	23-12-1999
			US 6572892 B1	03-06-2003
EP 1197207	A	17-04-2002	AU 7827301 A	11-04-2002
			CA 2358361 A1	10-04-2002
			EP 1197207 A2	17-04-2002
			JP 2002161033 A	04-06-2002
US 4132753	A	02-01-1979	NONE	
EP 0911038	A	28-04-1999	FR 2769839 A1	23-04-1999
			AT 194498 T	15-07-2000
			DE 69800210 D1	17-08-2000
			DE 69800210 T2	15-03-2001
			EP 0911038 A1	28-04-1999
			ES 2150305 T3	16-11-2000
			GR 3034549 T3	31-01-2001
			HK 1020527 A1	25-05-2001
			JP 3459349 B2	20-10-2003
			JP 11189538 A	13-07-1999
			PT 911038 T	29-12-2000
			US 6221853 B1	24-04-2001
WO 0076481	A	21-12-2000	IT MI991316 A1	14-12-2000
			AT 235234 T	15-04-2003
			AU 5077200 A	02-01-2001
			CA 2377299 A1	21-12-2000
			CN 1355694 T	26-06-2002
			DE 60001835 D1	30-04-2003
			DE 60001835 T2	13-11-2003
			DK 1198226 T3	21-07-2003
			WO 0076481 A1	21-12-2000
			EP 1198226 A1	24-04-2002
			EP 1287822 A2	05-03-2003
			ES 2194732 T3	01-12-2003
			JP 2003501458 T	14-01-2003
			NO 20016107 A	11-02-2002
			PT 1198226 T	31-07-2003
			TR 200200561 T2	21-06-2002
			US 6773720 B1	10-08-2004
GB 1323161	A	11-07-1973	NONE	

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No  
PCT/FR2004/000729

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0076478	A	21-12-2000	IT MI991317 A1	14-12-2000
			IT MI20000422 A1	03-09-2001
			AT 251449 T	15-10-2003
			AU 5680100 A	02-01-2001
			CA 2377301 A1	21-12-2000
			CN 1355693 T	26-06-2002
			DE 60005819 D1	13-11-2003
			DE 60005819 T2	06-05-2004
			DK 1183014 T3	09-02-2004
			WO 0076478 A1	21-12-2000
			EP 1183014 A1	06-03-2002
			ES 2208349 T3	16-06-2004
			JP 2003501457 T	14-01-2003
			NO 20016108 A	24-01-2002
			PT 1183014 T	31-12-2003
			TR 200200562 T2	21-05-2002
WO 9913864	A	25-03-1999	AU 9496798 A	05-04-1999
			CA 2302275 A1	25-03-1999
			EP 1028712 A2	23-08-2000
			JP 2002522354 T	23-07-2002
			WO 9913864 A2	25-03-1999
			US 2001006650 A1	05-07-2001

# RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande Internationale No

PC/FR2004/000729

**A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE**  
CIB 7 A61K9/16

Selon la classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois selon la classification nationale et la CIB

**B. DOMAINES SUR LESQUELS LA RECHERCHE A PORTE**

Documentation minimale consultée (système de classification suivi des symboles de classement)  
CIB 7 A61K

Documentation consultée autre que la documentation minimale dans la mesure où ces documents relèvent des domaines sur lesquels a porté la recherche

Base de données électronique consultée au cours de la recherche internationale (nom de la base de données, et si réalisable, termes de recherche utilisés)  
EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

**C. DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS**

Catégorie	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
A	WO 94/12157 A (KV PHARMACEUTICAL COMPANY) 9 juin 1994 (1994-06-09) revendications 1-3,6-8 page 9, ligne 1 - ligne 6 page 14, ligne 4 - ligne 19 page 17; exemple 1 page 19; exemple 4	1-7,9
X	WO 99/65448 A (IOULALEN, KARIM; ET AL.) 23 décembre 1999 (1999-12-23) cité dans la demande revendications 1-5,13-16 page 9; exemple 6  ----- -/--	15-17

☒ Voir la suite du cadre C pour la fin de la liste des documents

☒ Les documents de familles de brevets sont indiqués en annexe

\* Catégories spéciales de documents cités:

- \*A\* document définissant l'état général de la technique, non considéré comme particulièrement pertinent
- \*E\* document antérieur, mais publié à la date de dépôt international ou après cette date
- \*L\* document pouvant jeter un doute sur une revendication de priorité ou cité pour déterminer la date de publication d'une autre citation ou pour une raison spéciale (telle qu'indiquée)
- \*O\* document se référant à une divulgation orale, à un usage, à une exposition ou tous autres moyens
- \*P\* document publié avant la date de dépôt international, mais postérieurement à la date de priorité revendiquée

\*T\* document ultérieur publié après la date de dépôt international ou la date de priorité et n'appartenant pas à l'état de la technique pertinent, mais cité pour comprendre le principe ou la théorie constituant la base de l'invention

\*X\* document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément

\*Y\* document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme impliquant une activité inventive lorsque le document est associé à un ou plusieurs autres documents de même nature, cette combinaison étant évidente pour une personne du métier

\*&\* document qui fait partie de la même famille de brevets

Date à laquelle la recherche internationale a été effectivement achevée

7 octobre 2004

Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale

18/10/2004

Nom et adresse postale de l'administration chargée de la recherche internationale  
Office Européen des Brevets, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Fonctionnaire autorisé

Boulois, D

# RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande Internationale No

rci/FR2004/000729

## C.(suite) DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS

Catégorie	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
A	EP 1 197 207 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 17 avril 2002 (2002-04-17) revendications 1,13-16 page 5, ligne 43 - page 6, ligne 9 page 6; exemples 1-4 -----	1-4,6-9
X	US 4 132 753 A (MITCHELL S. BLICHARE) 2 janvier 1979 (1979-01-02) revendications 1,2 -----	1-4,6,7, 9
A	EP 0 911 038 A (SALSARULO, ODETTE; ET AL.) 28 avril 1999 (1999-04-28) revendications 1-3 exemples 1-3 -----	1-4,6,7, 9
X	WO 00/76481 A (CIP NINETY TWO 92 S A ; AJANI MAURO (PA); VILLA ROBERTO (PA); FOSSATI) 21 décembre 2000 (2000-12-21) page 7 - page 10; exemples -----	1-14, 18-20
X	GB 1 323 161 A (WYETH JOHN & BROTHER LTD) 11 juillet 1973 (1973-07-11)  page 2 - page 3; exemples -----	1-6, 8-14, 18-20
X	WO 00/76478 A (CIP NINETY TWO 92 S A ; AJANI MAURO (PA); VILLA ROBERTO (PA); FOSSATI) 21 décembre 2000 (2000-12-21) page 15; exemple 8 -----	1-10, 12-14, 18-20
X	WO 99/13864 A (SHIRE LAB INC) 25 mars 1999 (1999-03-25) page 2, alinéa 3 page 9, alinéa 1 page 41 - page 42; exemple 8 -----	1-14, 18-20

# RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Renseignements relatifs aux membres de familles de brevets

Demande internationale No

PCT/FR2004/000729

Document brevet cité au rapport de recherche		Date de publication	Membre(s) de la famille de brevet(s)	Date de publication
WO 9412157	A	09-06-1994	AU 5681294 A	22-06-1994
			CA 2150119 A1	09-06-1994
			DE 69332801 D1	30-04-2003
			DE 69332801 T2	29-01-2004
			EP 0670716 A1	13-09-1995
			ES 2194863 T3	01-12-2003
			JP 2949448 B2	13-09-1999
			JP 8505841 T	25-06-1996
			KR 168715 B1	15-01-1999
			WO 9412157 A1	09-06-1994
			US 5494681 A	27-02-1996
WO 9965448	A	23-12-1999	FR 2779962 A1	24-12-1999
			AU 4151099 A	05-01-2000
			CA 2341580 A1	23-12-1999
			EP 1030687 A2	30-08-2000
			WO 9965448 A2	23-12-1999
			US 6572892 B1	03-06-2003
EP 1197207	A	17-04-2002	AU 7827301 A	11-04-2002
			CA 2358361 A1	10-04-2002
			EP 1197207 A2	17-04-2002
			JP 2002161033 A	04-06-2002
US 4132753	A	02-01-1979	AUCUN	
EP 0911038	A	28-04-1999	FR 2769839 A1	23-04-1999
			AT 194498 T	15-07-2000
			DE 69800210 D1	17-08-2000
			DE 69800210 T2	15-03-2001
			EP 0911038 A1	28-04-1999
			ES 2150305 T3	16-11-2000
			GR 3034549 T3	31-01-2001
			HK 1020527 A1	25-05-2001
			JP 3459349 B2	20-10-2003
			JP 11189538 A	13-07-1999
			PT 911038 T	29-12-2000
			US 6221853 B1	24-04-2001
WO 0076481	A	21-12-2000	IT MI991316 A1	14-12-2000
			AT 235234 T	15-04-2003
			AU 5077200 A	02-01-2001
			CA 2377299 A1	21-12-2000
			CN 1355694 T	26-06-2002
			DE 60001835 D1	30-04-2003
			DE 60001835 T2	13-11-2003
			DK 1198226 T3	21-07-2003
			WO 0076481 A1	21-12-2000
			EP 1198226 A1	24-04-2002
			EP 1287822 A2	05-03-2003
			ES 2194732 T3	01-12-2003
			JP 2003501458 T	14-01-2003
			NO 20016107 A	11-02-2002
			PT 1198226 T	31-07-2003
			TR 200200561 T2	21-06-2002
			US 6773720 B1	10-08-2004
GB 1323161	A	11-07-1973	AUCUN	

# RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Renseignements relatifs aux membres de familles de brevets

Requête internationale No

PCT/FR2004/000729

Document brevet cité au rapport de recherche		Date de publication	Membre(s) de la famille de brevet(s)	Date de publication
WO 0076478	A	21-12-2000	IT MI991317 A1	14-12-2000
			IT MI20000422 A1	03-09-2001
			AT 251449 T	15-10-2003
			AU 5680100 A	02-01-2001
			CA 2377301 A1	21-12-2000
			CN 1355693 T	26-06-2002
			DE 60005819 D1	13-11-2003
			DE 60005819 T2	06-05-2004
			DK 1183014 T3	09-02-2004
			WO 0076478 A1	21-12-2000
			EP 1183014 A1	06-03-2002
			ES 2208349 T3	16-06-2004
			JP 2003501457 T	14-01-2003
			NO 20016108 A	24-01-2002
			PT 1183014 T	31-12-2003
			TR 200200562 T2	21-05-2002
WO 9913864	A	25-03-1999	AU 9496798 A	05-04-1999
			CA 2302275 A1	25-03-1999
			EP 1028712 A2	23-08-2000
			JP 2002522354 T	23-07-2002
			WO 9913864 A2	25-03-1999
			US 2001006650 A1	05-07-2001